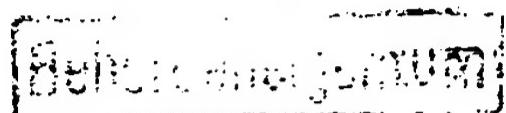


(51)

Int. Cl. 2:

A 61 K 7/42

(19) **BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND**



DE 27 34 823 A 1

(11)

Offenlegungsschrift 27 34 823

(21)

Aktenzeichen: P 27 34 823.8

(22)

Anmeldetag: 2. 8. 77

(23)

Offenlegungstag: 16. 2. 78

(30)

Unionspriorität:

(32) (33) (31)

4. 8. 76 Frankreich 7623799

(54)

Bezeichnung:

Sonnenschutzmittel

(71)

Anmelder:

Goupil, Jean-Jacques, Cachan (Frankreich)

(74)

Vertreter:

**Tiedtke, H., Dipl.-Ing.; Bühling, G., Dipl.-Chem.; Kinne, R., Dipl.-Ing.;
Grupe, P., Dipl.-Ing.; Pat.-Anwälte, 8000 München**

(72)

Erfinder:

Nichtnennung beantragt

1

Patentansprüche

1. Sonnenschutzmittel auf der Basis von natürlichem Bergamottöl, dadurch gekennzeichnet, daß es zwischen 2,75 mg 5 und 27,50 mg 5-Methoxypsoralen (Bergapten) pro 100 g des Sonnenschutzmittels und mindestens 1,5% Äthylhexylparamethoxycinnamat und mindestens 1% Trimethylbenzylidenheptanon, die als UV-Filter B dienen, enthält, wobei die genannten Stoffe mit einer geeigneten, fetten Grundmasse vermischt sind.

10

2. Sonnenschutzmittel nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß die in Anspruch 1 beschriebene Bergaptenmenge zum Teil aus im Sonnenschutzmittel enthaltenem, natürlichem, reinem Bergamottöl, wobei das Bergamottöl in einer Menge von 15 höchstens 3% vorliegt, und zum anderen Teil aus zur Erreichung der gewünschten Gesamtmenge zugesetztem reinem 5-Methoxypsoralen (Bergapten) stammt.

3. Sonnenschutzmittel nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß es pro 100 g des Sonnenschutzmittels auf der Basis einer vitaminisierten, fetten Grundmasse

20 7,5 mg Bergapten,
2 g Äthylhexylparamethoxycinnamat und
1 g Trimethylbenzylidenheptanon
25 enthält.

4. Sonnenschutzmittel nach Ansprüchen 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß es pro 100 g des Sonnenschutzmittels auf der Basis einer fetten Grundmasse

30 12 mg Bergapten in der Form von 3g reinem Bergamottöl mit einem Bergaptengehalt von 0,4%,
3 mg reines Bergapten,
3 g Äthylhexylparamethoxycinnamat und
1 g Trimethylbenzylidenheptanon
35 enthält.

809807/0622

ORIGINAL INSPECTED

TIEDTKE - BÜHLING - KINNE - GRUPE

- 2 - 2734823

Patentanwälte:

Dipl.-Ing. H. Tiedtke
Dipl.-Chem. G. Bühling
Dipl.-Ing. R. Kinne
Dipl.-Ing. P. Grupe

Bavariaring 4, Postfach 20 24 03

8000 München 2

Tel.: (0 89) 53 96 53

Telex: 5-24 845 tipat

cable: Germaniapatent München

2. August 1977

B 8353 case HP/NC-G.6483

Jean-Jacques Goupil

Cachan / Frankreich

Sonnenschutzmittel

809807/0622

X1/8

Oberpostamt München Kto. 1911 00 - Postscheck München Kto. 670 43 804

DE 001104 1977 07 22

1

Beschreibung

5 Bekanntlich beruht die natürliche Sonnenbräunung auf der Einwirkung von UV-Strahlen auf die Melanozyten der menschlichen Haut, wobei die Melanozyten die für die Melanogenese verantwortlichen, besonderen Zellen an der Oberfläche der Lederhaut sind.

10 Diese Zellen sind in der Lage, Melanin-Körnchen oder Melanosomen anzusammeln.

15 Unter natürlichen Bedingungen gibt der Melanozyt die Melanosomen an die Oberhaut ab, wo sie von anderen Zellen, den Keratinozyten, aufgenommen werden, die sie ansammeln.

20 Die Übertragung geschieht mittels einer Art von Zellfortsätzen, Dendriten genannt.

25 Man erhält auf diese Weise ein natürliches Sonnenschutzfilter, das die Haut schützt und ein Hindernis für die schädliche Einwirkung des UV-Lichts bildet.

30 Wenn man eine geeignete Zubereitung, die natürliches Bergamottöl enthält, auf die Haut aufstreicht, so verbindet sich die Wirkung der Sonnenstrahlung in irgendeiner Weise mit der Wirkung des natürlichen Bergamottöls und man stellt ein Auslösen der Melanogenese, verbunden mit einem Anwachsen ihrer Schnelligkeit und ihrer Intensität fest. Der Vorteil der sog. Bräunungsmittel, die natürliches Bergamottöl enthalten, besteht demnach darin, daß sie eine Verkürzung der Zeitdauer erlauben, über die man sich der Sonne aussetzen muß, um durch die Bräunung einen guten natürlichen Schutz der Haut gegen die Sonne zu erzielen.

35 Wenn jedoch in den Bräunungsmitteln eine zu große Meng des natürlichen Bergamottöls enthalten ist, so kann dies in gewissen Fällen durch Zusammenwirkung des im Überschuß vorhandenen Bergamottöls mit den UV-Strahlen der Sonne zu schäd-

809807/067?

ORIGINAL INSPECTED

lichen Wirkungen auf die Haut führen. Aus diesem Grund hat man sich bisher bei der Herstellung von Bräunungsmitteln, die natürliches Bergamottöl enthalten, nach einer sehr niedrigen Höchstgrenze für den Gehalt an Bergamottöl gerichtet.

5

Diese sehr niedrige Höchstgrenze wurde in der Praxis aus dem Grund beachtet, weil man der Meinung war, daß Mischungen auf wässrig-alkoholischer Grundlage für die Haut gefährlich werden können, wenn ihr Gehalt an natürlichem, reinem Bergamott-
10 öl die Größenordnung von 0,60 Gewichtsprozent bezüglich des betrachteten Sonnenschutzmittels übersteigt.

Der Gehalt der bislang hergestellten Bräunungsmittel an reinem, natürlichem Bergamottöl überstieg, welcher Grund-
15 stoff auch immer eingesetzt wurde, selbst im Fall eines fetten Grundstoffs, in der Tat nie die Obergrenze von 0,60 Gewichts-
prozent.

Die Verwendung dieser begrenzten Mengen, die von ver-
20 ständlicher Besorgnis bestimmt war, war dadurch gerechtfertigt, weil man wußte, daß der bezüglich der photodynamisierenden Wirkung hauptsächlich aktive, im natürlichen, reinen Bergamott-
öl enthaltene Stoff 5-Methoxypsoralen, auch "Bergapten" ge-
nannt, ist, und daß der Gehalt des Bergamottöls an diesem Stoff
25 nicht nur von der Sonneneinstrahlung, dem Klima und den Wetter-
bedingungen, sondern auch, und zwar in beachtlicher Weise,
von der Erntezeit abhängt.

Andererseits ist bekannt, daß es möglich ist, durch
30 Gaschromatographie den Bergaptengehalt eines Bergamottöls mit ausreichender Genauigkeit zu bestimmen.

Die Anwendung dieser wissenschaftlichen Meßmethoden führte zu der überraschenden Feststellung, daß es erfindungs-
35 gemäß möglich ist, in rationeller Weise und ohne Gefahr höhere Mengen des reinen, natürlichen Bergamottöls als bisher ge-
bräuchlich zu verwenden.

809807/0622

1 Zur Bestimmung der Bergaptenmengen, die man ohne Gefahr in den erfindungsgemäß hergestellten Sonnenschutzmitteln verwenden kann, wurden zunächst systematische Bräunungsversuche an Gruppen von zwanzig Personen mit den Haupttypen
 5 I, II, III und IV durchgeführt. Die Dermatologen unterscheiden bekanntlich vier Hauttypen, den Hauttyp I, der nicht braun wird, sich aber stark rötet, d.h. sehr leicht Sonnenbrand bekommt, den Hauttyp II, der lange braucht, um braun zu werden, aber Sonnenbrand bekommt, den Hauttyp III, der leicht braun
 10 wird und selten Sonnenbrand bekommt und den Hauttyp IV, der auf vollkommene Weise und ohne Probleme braun wird.

Die Versuchsergebnisse sind in der nachfolgenden Tabelle dargestellt. Die Tabelle zeigt, daß es bis zu einem Bergaptengehalt von 20 mg pro 100 g des Sonnenschutzmittels bei keinem Hauttyp einen Sonnenbrand gab, und daß die Zeitdauer bis zur Erzielung einer optimalen Bräunung um so kürzer ist, je höher der Bergaptengehalt der Mischung ist.

20	Bergapten (in mg pro 100 g des Sonnenschutz- mittels aus einer fetten Grundmasse)	Hauttyp II, Zeitdauer bis zur Erzielung einer optimalen Bräunung		Sonnenbrand (alle Haut- typen)
		mit Bergapten	ohne Bergapten	
25	3	12 h	24h in 6 Tagen	keiner
	5	10 h	24h in 6 Tagen	keiner
	10	9 h	24h in 6 Tagen	keiner
	15	8 h	24h in 6 Tagen	keiner
	20	7 h	24h in 6 Tagen	keiner
	25	6 h	24h in 6 Tagen	1 Fall pro 20 Personen vom Hauttyp I
	30	5 h	24h in 6 Tagen	8 Fälle pro 20 Personen vom Hauttyp I, 4 Fälle pro 20 Personen vom Hauttyp II

809807/0622

1 Erfindungsgemäß wurde aufgrund dieser Versuchsergebnisse
eine neue Höchstgrenze für den Bergaptengehalt, d.h. für
den Gehalt an 5-Methoxypsoralen eines Sonnenschutzmittels
auf der Basis einer fetten Grundmasse bestimmt. Diese
5 Höchstgrenze hat die Größenordnung von 27,5 mg Bergapten
pro 100 g des Sonnenschutzmittels auf der Basis einer fetten
Grundmasse.

10 Die Untergrenze ist variabel und hängt von der ge-
wünschten Wirksamkeit ab, man kann sie aber auf 2,75 mg
Bergapten pro 100 g des Sonnenschutzmittels auf der Basis
eines fetten Grundstoffs festsetzen, um einen Bräunungs-
effekt zu erzielen, der viel rascher eintritt als bei den
bisher bekannten Sonnenschutzmitteln.

15 Im folgenden wird die Zusammensetzung der erfunden-
gemäßen Sonnenschutzmittel näher beschrieben. Die Bergapteng-
menge B, die man pro 100 g des Sonnenschutzmittels einsetzen
muß, um einen sehr beschleunigten Bräunungseffekt zu erzielen,
20 ohne daß die Gefahr von Sonnenbrand besteht, liegt zwischen
2,75 mg und 27,5 mg.

25 Wenn α der Bergaptengehalt des reinen, natürlichen
Bergamottöls ist, so gilt für die Menge E des Bergamottöls,
die man pro 100 g des Sonnenschutzmittels einsetzen muß,
 $E = B/\alpha$, E liegt daher zwischen $(2,75/\alpha)$ [mg] und $(27,5/\alpha)$
[mg].

30 Der Bergaptengehalt der unterschiedlichen reinen,
natürlichen Bergamottöle, die verwendet wurden, wurde sorg-
fältig mittels Gaschromatographie bestimmt, er kann zwischen 0,1%
und 0,5% variieren.

35 Aus diesen Angaben resultiert, daß die Höchstmenge
des reinen, natürlichen Bergamottöls, die man pro 100 g des
Sonnenschutzmittels einsetzt, zwischen 5,5 g ($B = 27,5$ mg
und $\alpha = 0,5\%$) und 27,5 g ($B = 27,5$ mg und $\alpha = 0,1\%$) betragen
kann.

809807/0622

1 Eine solche Menge an reinem, natürlichem Bergamottöl
wird dem Sonnenschutzmittel in Wirklichkeit nicht zugegeben.
Man kann sich überlegen, daß die maximale Dosierung 3 g des
reinen natürlichen Bergamottöls pro 100 g des Sonnenschutzmittels
5 betragen sollte, was einer Dosierung von 3% entspricht, denn
einerseits wird der optimale Duft des Sonnenschutzmittels mit
einem Bergamottölgehalt von 2% bis 3% erreicht und anderer-
seits ist es möglich, daß ein 3% überschreitender Gehalt an
natürlichem Bergamottöl von gewissen Haupttypen nicht ver-
10 tragen wird.

Bei Verwendung eines Bergamottöls mit einem Bergapten-
gehalt von 0,4% entspricht die Zugabe von 3% des Bergamott-
öls zum Sonnenschutzmittel einer Menge von 12 mg Bergapten
15 pro 100 g des Sonnenschutzmittels. Falls ein Sonnenschutzmittel
mit beschleunigter Bräunungswirkung gewünscht wird, so kann man
den Maximalgehalt von 27,5 mg Bergapten pro 100 g des Produkts
dadurch erreichen, daß man dem reinen, natürlichen Bergamott-
öl die komplementäre Menge des reinen 5-Methoxypsoralens
20 (Bergaptens), im vorstehend beschriebenen Fall 15,5 mg, zu-
fügt.

Die erfindungsgemäßen Sonnenschutzmittel unterscheiden
sich in folgenden zwei Punkten von den schon bekannten Sonnen-
schutzmitteln: ihr Maximalgehalt an Bergapten beträgt mit 27,5
25 mg pro 100 g des Sonnenschutzmittels fast das Zehnfache des
Maximalgehalts an Bergapten der schon bekannten Sonnenschutz-
mittel, der bei 2,5 mg liegt, zum anderen wird der erhöhte
Bergaptengehalt der erfindungsgemäßen Sonnenschutzmittel da-
30 durch erreicht, daß man das Bergapten teils in Form von reinem,
natürlichem Bergamottöl, maximal von 3% Bergamottöl, und zum
Teil in Form der für die Erreichung der gewünschten
Konzentration nötigen komplementären Menge des reinen
Bergaptens zusetzt.

35

Die erfindungsgemäßen Sonnenschutzmittel enthalten
vorzugsweise 5 mg bis 20 mg Bergapten pro 100 g der Mischung.

809807/0622

1 Zur Herstellung der erfindungsgemäßen Sonnenschutzmittel werden vorzugsweise reine, natürliche Bergamottöle mit einem Bergaptengehalt in der Größenordnung von 0,4% verwendet.

5

Erfindungsgemäß werden zur Herstellung der Sonnenschutzmittel fette Grundmassen eingesetzt, ausgeschlossen ist die Verwendung einer wässrigen Grundmasse, einer Emulsion, bei der die kontinuierliche Phase Wasser ist, und insbesondere wässrig-alkoholischer Grundmassen. Zur Herstellung von flüssigen Bräunungsmitteln kann man pflanzliche oder mineralische Öle, zur Herstellung von kremigen Bräunungsmitteln kann man Lanoline oder andere tierische oder mineralische Fette einsetzen.

15

Außerdem ist es notwendig, dem Sonnenschutzmittel Substanzen beizumischen, die als UV-Filter B dienen, z.B. Äthylhexylparamethoxycinnamat und Trimethylbenzylidenheptanon. Vorzugsweise soll der Gehalt an Äthylhexylparamethoxycinnamat, das zur Abschirmung der Strahlung mit einer Wellenlänge zwischen 260 nm und 340 nm dient, 1,5%, und der Gehalt an Trimethylbenzylidenheptanon, das zur Abschirmung der Strahlung mit einer Wellenlänge zwischen etwa 220 nm und 315 nm dient, 1% nicht unterschreiten. Der Höchstgehalt an diesen zwei Filterstoffen beträgt jeweils 4%. Die genannten Stoffe sind nur als Beispiele für UV-Filter B angeführt, es können also auch andere geeignete Filter verwendet werden.

Folgende Beispiele dienen der näheren Erläuterung
30 der Erfindung:

Beispiel 1

Bräunungsmittel mit folgender Zusammensetzung pro 100 g der Gesamtmasse:

35 7,5 mg Bergapten

2 g Äthylhexylparamethoxycinnamat

1 g Trimethylbenzylid heptanon

Restmenge (zur Erreichung von 100 g) als fette Grundmasse auf der Basis von Isopropylmyristat und pflanzlichen

809807/0622

2734823

B 8353

-9-

1 und mineralischen Ölen.

Die Mischung kann als Ergänzung natürlich auch
solche zusätzlichen Substanzen enthalten, die eine günstige
5 Wirkung auf die Haut haben, z.B. verschiedene Vitamine
oder Stoffe, die zusätzliche, komplementäre Filter darstellen.

Beispiel 2

10 Bräunungsmittel mit folgender Zusammensetzung pro 100 g
der Gesamtmasse:

3 g reines, natürliches Bergamottöl mit einem Bergaptengehalt von 0,4% (entsprechend 12 mg Bergapten)

3 mg reines Bergapten

15 3 g Äthylhexylparamethoxycinnamat

1 g Trimethylbenzylidenheptanon

809807/0622